

СЕЛЕКТИВНЫЕ ИНГИБИТОРЫ КАРБОКСИЛЭСТЕРАЗЫ НА ОСНОВЕ ПОЛИФТОРАЛКИЛ-2-АРИЛГИДРАЗОНО-3-ОКСОБУТАНОАТОВ

Елькина Н.А.^(1,2), Щегольков Е.В.⁽²⁾, Худина О.Г.⁽²⁾,

Бургарт Я.В.⁽²⁾, Салоутин В.И.⁽²⁾

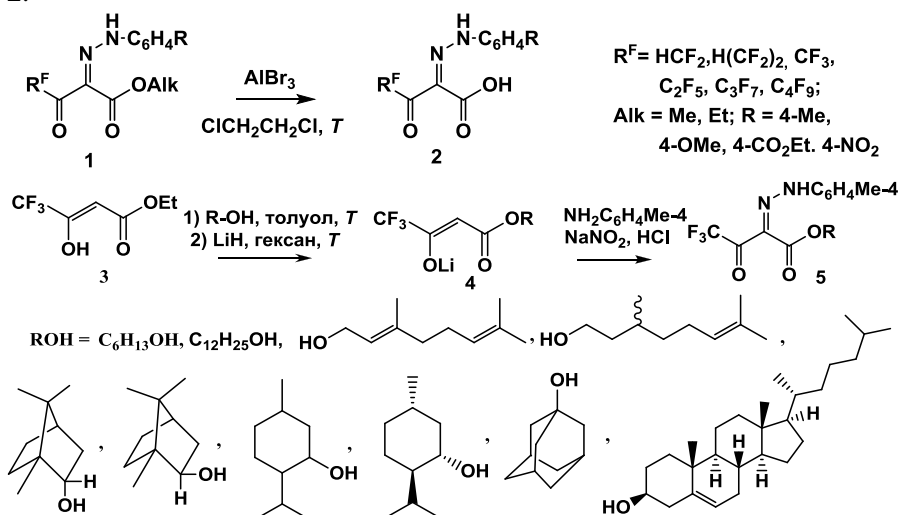
⁽¹⁾ Уральский федеральный университет

620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН

620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Недавно обнаружено, что алкил-2-арилгидразон-3-полифторалкил-3-оксобутираты **1** являются эффективными селективными ингибиторами карбоксилэстеразы (КЭ) [1]. С целью расширения ряда ингибиторов этого класса нами разработан метод получения 2-арилгидразон-3-полифторалкил-3-оксобутирановых кислот **2** в результате деалкилирования их алкиловых эфиров **1** под действием AlBr_3 . Предложен способ получения трифторметилсодержащих 2-арилгидразон-3-оксоэфиров **5**, содержащих остаток высшего или природного спирта, через азосочетание солей арилдiazония с литиевыми солями оксоэфиров **2**, уже содержащих фрагмент такого спирта. Для получения солей **2** эффективно использовать переэтерификации этилтрифторацетилата **1** под действием спирта с выделением переэтерифицированных эфиров через литиевые соли **2**.



Исследование эстеразного профиля соединений **2** и **5** выявило их высокую антикарбоксилэстеразную активность (ингибирование КЭ до 92.5%). Кроме того, установлена высокая антирадикальная активность кислот **2** (ТЕАС до 1.7).

1. Пат. 2574291 Российская Федерация. 2015 / Бургарт Я.В. и др.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ (грант 16-03-00417).